

**Alpha-linolenic acid dietary supplement prep'd. from kiwi seed oil****Publication number:** FR2721517 (A1)**Also published as:****Publication date:** 1995-12-29 FR2721517 (B1)**Inventor(s):** MAINGAULT MARTINE**Cited documents:****Applicant(s):** BIOVALEUR SA [FR] JP64003117 (A)**Classification:****- International:** A23L1/30; A61K36/00; A61K36/185; A23L1/30; A61K36/00;  
A61K36/185; (IPC1-7): A61K35/78**- European:** A23L1/30C2; A61K36/185**Application number:** FR19940007803 19940624**Priority number(s):** FR19940007803 19940624**Abstract of FR 2721517 (A1)**

Dietary supplement for children and adults comprises kiwi seed oil in an oral formulation.

Data supplied from the *esp@cenet* database — Worldwide

(19) RÉPUBLIQUE FRANÇAISE  
INSTITUT NATIONAL  
DE LA PROPRIÉTÉ INDUSTRIELLE  
PARIS

(11) N° de publication :  
(à n'utiliser que pour les  
commandes de reproduction)

2 721 517

(21) N° d'enregistrement national :

94 07803

(51) Int Cl<sup>e</sup> : A 61 K 35/78

(12)

DEMANDE DE BREVET D'INVENTION

A1

(22) Date de dépôt : 24.06.94.

(71) Demandeur(s) : Société dite: BIOVALEUR (S.A.) —  
FR.

(30) Priorité :

(72) Inventeur(s) : Maingault Martine.

(43) Date de la mise à disposition du public de la  
demande : 29.12.95 Bulletin 95/52.

(73) Titulaire(s) :

(56) Liste des documents cités dans le rapport de  
recherche préliminaire : Se reporter à la fin du  
présent fascicule.

(74) Mandataire : Cabinet Dawidowicz.

(60) Références à d'autres documents nationaux  
apparentés :

FR 2 721 517 - A1



5

10

15       Composition pharmaceutique utilisée en tant que complément alimentaire

La présente invention concerne une composition pharmaceutique utilisée en tant que complément alimentaire, en particulier, 20 dans l'alimentation humaine, chez l'homme ou chez l'enfant.

Le corps humain a besoin pour son développement ou son maintien d'un certain nombre d'éléments qui ne peuvent être fournis que par l'alimentation quotidienne.

25       Tel est le cas de l'acide alpha-linolénique et de l'acide linoléique, acides gras essentiels dits poly-insaturés, qui présentent tous deux la particularité de ne pas être synthétisés par le corps humain. Le rôle de ces deux acides gras est aujourd'hui parfaitement défini. En effet, les recherches scientifiques ont montré l'importance de l'acide alpha-linolénique sur le développement du cerveau de l'enfant. Une carence de cet acide dans l'alimentation entraîne pour le sujet des retards dans l'apprentissage et 30 des perturbations neurologiques et visuelles. Les nutritionnistes recommandent pour l'enfant un apport minimal de 1 g/jour. Son apport dans l'alimentation est généralement 35

insuffisant. De même, durant le développement cérébral du foetus, pendant la grossesse, le besoin en acides gras polyinsaturés est fondamental et extrêmement élevé. Le passage et l'accumulation des acides gras de la série n-3 (acide alpha-linolénique et dérivés), dans le cerveau, apparaît durant les trois derniers mois de la grossesse. Aussi l'acide alpha-linolénique doit-il être apporté à l'enfant par l'alimentation de la mère, durant la grossesse et la lactation pour assurer un développement harmonieux du cerveau et de la rétine. De même, ces recherches scientifiques ont montré que l'acide alpha-linolénique favorise chez l'adulte la reconstitution du réseau neuronal et contribue directement à une meilleure transmission des messages entre neurones. Les nutritionnistes recommandent en conséquence pour l'adulte un apport minimal de 1,4 g/jour. Il a également été montré de façon expérimentale qu'une carence en acide alpha-linolénique affecte parfois de façon définitive le fonctionnement normal du cerveau. En effet, en laboratoire, des expériences sur l'animal, en particulier le rat, ont mis en évidence les effets néfastes d'alimentation carencée en acide alpha-linolénique. Ainsi, les animaux soumis à un régime carencé voient l'activité de l'enzyme de Na-K-ATPase (enzyme cérébrale) diminuer de moitié. De cette enzyme dépend la qualité de la transmission des messages entre neurones, conditionnant ainsi l'accroissement des potentialités cérébrales. On constate également que la réponse électrique des cellules de la rétine (ou des neurones) à une excitation lumineuse diminue sensiblement : le seuil de détection est atteint chez l'animal carencé avec un éclairement dix fois plus puissant.

La présence d'acide alpha-linolénique dans l'alimentation confère également une plus grande résistance face aux substances neurotoxiques. De plus, les études scientifiques ont montré un effet protecteur de l'acide alpha-linolénique et de ses dérivés vis-à-vis des accidents vasculaires cérébraux, puisque la supplémentation en acides gras

polyinsaturés de la série n-3 (acide alpha-linolénique et dérivés) diminue significativement l'extension des dommages cérébraux consécutifs à une ischémie cérébrale.

5 Enfin, les résultats des tests dits "d'apprentissage" révèlent des phénomènes irréversibles : pour un animal carencé, la période d'apprentissage et de désapprentissage est plus longue: nourris de nouveau normalement, les rats demeurent pour le reste de leurs jours moins aptes à 10 apprendre et à désapprendre que les autres.

On a également constaté que le rapport acide linoléïque/acide alpha-linolénique ne doit pas être inférieur à quatre. En effet, les mécanismes compétitifs entre l'acide alpha-linolénique et l'acide linoléïque risquent d'avoir des effets indésirables si le rapport acide linoléïque/acide alpha-linolénique est trop faible. Parmi ceux-ci, un temps de saignement prolongé et l'abaissement de la concentration d'acide arachidonique, dont la carence induit une croissance 15 pondérale plus faible, sont les plus connus. Le risque de formation de lésions d'athérosclérose et de thrombose est 20 également plus grand.

Le but de la présente invention est donc de pallier les 25 inconvénients précités en proposant une composition pharmaceutique utilisable en tant que complément alimentaire permettant d'optimiser le rapport acide linoléïque/acide alpha-linolénique dans l'alimentation humaine et donc 30 d'assurer le maintien ou le développement du capital cérébral chez l'enfant ou chez l'homme.

L'invention concerne à cet effet une composition pharmaceutique administrable par voie orale utilisée en complément de l'alimentation, en particulier chez l'adulte ou 35 chez l'enfant, en vue du maintien d'un rapport acide linoléïque/acide alpha-linolénique optimal pour assurer la

pérennité ou le développement du capital cérébral, caractérisée en ce qu'elle comprend comme constituant essentiel au moins de l'huile de pépins de kiwi.

5 L'invention sera bien comprise à la lecture de la description suivante d'exemple de réalisation.

La composition pharmaceutique, objet de l'invention, 10 constitue un complément alimentaire indispensable pour prévenir un déséquilibre entre l'acide linoléïque et l'acide alpha-linolénique dont les conséquences ont été décrites ci-dessus et éviter toute carence en acide alpha-linolénique chez l'adulte ou l'enfant. Selon sa destination (enfant ou adulte), la composition pharmaceutique pourra présenter des 15 formes galéniques variables ainsi qu'un nombre et une qualité de constituants différents. Cette composition pharmaceutique se présentera généralement sous forme d'une composition liquide ou solide en particulier sous forme pulvérulente incorporée à un support ou à un excipient pharmaceutiquement acceptable solide ayant un rôle de vecteur et/ou 20 d'antioxydant. A titre d'exemple, lorsque cette composition pharmaceutique est destinée à être administrée à l'enfant, en vue de favoriser le développement cérébral de ce dernier, la composition pharmaceutique sera réalisée à base d'huile de 25 pépins de kiwi, de saccharose, d'huile de soja, de lécithine de soja, de vitamine E, de sacharinate de sodium et d'arômes. Les nutritionnistes recommandent pour l'enfant un apport minimal en acide alpha-linolénique de 1 g/jour. Si la 30 composition est présentée sous forme de capsules à sucer pour les enfants de 5 à 12 ans par exemple, on fera en sorte qu'elle apporte environ 112 mg d'acide alpha-linolénique. Les arômes pourront être choisis par exemple à base de chocolat et d'essence d'orange. Les doses recommandées sont de 3 à 6 35 capsules à sucer par jour. La vitamine E est utilisée comme antioxydant. La capsule sera choisie à base de glycérine, de gélatine et d'amidon. L'analyse d'une telle composition en grammes pour cent grammes fournit les éléments suivants :

Composition en g  
pour 100 g

	glucides :	32,2
5	lipides :	62,3
	acides gras mono-insaturés :	6,6
	acides gras poly-insaturés :	42,8
	(dont acide alpha-linolénique	35)
	acides gras saturés :	12,8

10

Bien évidemment, d'autres formes galéniques peuvent être retenues, en particulier des compositions pharmaceutiques sous forme de granulés, de capsules, de pilules, gélules, poudre, solution, émulsion, gelée ou similaires sont 15 parfaitement acceptables. De même, la composition de la capsule n'est citée qu'à titre d'exemple. En effet, parmi les éléments acceptables pour la fabrication de telles capsules, on citera le lactose, le stéarate de magnésium, l'amidon, la gélatine, le talc, l'agar, la pectine, la gomme arabique, 20 l'huile d'olive, l'huile de césame, le beurre de cacao, l'éthylène glycol, etc., ces éléments étant choisis individuellement ou combinés.

En ce qui concerne la composition pharmaceutique destinée à 25 l'adulte, cette composition pourra être simplifiée. Les nutritionnistes recommandent pour l'adulte un apport minimal de 1,4 g/jour. La capsule à base d'huile de pépins de kiwi proposée par l'inventeur apportera environ 139 mg d'acide alpha-linolénique. A titre d'exemple, la composition de cette 30 capsule pourra être la suivante : huile de pépins de kiwi : 200 g, huile de germe de blé. L'huile de germe de blé présente l'avantage d'être riche en vitamine E qui constitue un excellent antioxydant et prévient le vieillissement cérébral. La capsule sera de nouveau à base de glycérine, de 35 gélatine et d'amidon. A titre d'exemple, l'analyse en grammes pour 100 g de la composition fournit les éléments suivants :

Analyse de la  
Composition en g  
pour 100 g

5	lipides :	100
	acides gras mono-insaturés :	5
	acides gras poly-insaturés :	16,5
	acides gras poly-insaturés :	69,5
	(dont acide alpha-linolénique	34,7)
10	acides gras saturés :	14,2

Les doses recommandées chez l'adulte sont de 3 à 6 capsules par jour.

15 Bien évidemment, de nouveau, toute autre forme galénique peut être retenue. Il peut être intéressant également, que ce soit chez l'homme ou chez l'enfant, d'utiliser une composition pharmaceutique se présentant sous forme d'une solution liquide pulvérisable au moyen d'un fluide vecteur tel qu'un gaz, en particulier de l'azote. On peut également prévoir de présenter la composition pharmaceutique sous forme d'une dose individuelle unique conditionnée de manière étanche à l'air dans un emballage jetable, la prise de la composition s'effectuant quotidiennement.

25 Grâce aux propriétés de l'huile de pépins de kiwi particulièrement riche en acide alpha-linolénique, les compositions pharmaceutiques nécessaires pour compléter l'alimentation se révèlent particulièrement simples et donc 30 sans danger dans le cas d'administrations quotidiennes répétées.

## REVENDICATIONS

1. Composition pharmaceutique administrable par voie orale utilisée en complément de l'alimentation, en particulier chez l'adulte ou chez l'enfant, en vue du maintien d'un rapport acide linoléique/acide alpha-linolénique optimal pour assurer la pérennité ou le développement du capital cérébral, caractérisée en ce qu'elle comprend comme constituant essentiel au moins de l'huile de pépins de kiwi.
- 5  
2. Composition pharmaceutique selon la revendication 1, caractérisée en ce qu'elle se présente sous forme d'une composition liquide ou solide en particulier sous forme pulvérulente incorporée à un support ou à un excipient pharmaceutiquement acceptable solide ayant un rôle de vecteur et/ou d'antioxydant.
- 15  
3. Composition pharmaceutique selon l'une des revendications 1 et 2, caractérisée en ce qu'elle affecte une forme galénique choisie parmi les formes suivantes : comprimé, granulé, capsule, pilule, gélule, émulsion, gelée.
- 20  
25  
4. Composition pharmaceutique selon l'une des revendications 1 à 3, caractérisée en ce que le support ou l'excipient pharmaceutiquement acceptable est une composition à base d'éléments tels que du lactose et/ou du stéarate de magnésium et/ou de l'amidon et/ou de la gélatine et/ou du talc et/ou de l'agar et/ou de la pectine et/ou de la gomme arabique et/ou de l'huile d'olive et/ou de l'huile de césame et/ou du beurre de cacao et/ou de l'éthylène glycol.

5. Composition pharmaceutique selon l'une des revendications  
1 à 4,

caractérisée en ce qu'elle comprend outre de l'huile de pépin de kiwi et un excipient, un ou plusieurs additifs, en particulier des anti-oxydants et des arômes.

6. Composition pharmaceutique selon l'une des revendications  
1 à 5,

10 caractérisée en ce qu'elle comprend de l'huile de pépin de kiwi, du saccharose, de l'huile de soja, de la lécithine de soja, de la vitamine E, du sacharinate de sodium et des arômes.

7. Composition pharmaceutique selon l'une des revendications  
15 1 à 5,

caractérisée en ce qu'elle comprend de l'huile de pépin de kiwi et de l'huile de germe de blé.

8. Composition pharmaceutique selon l'une des revendications  
20 1 à 7,

caractérisée en ce que le support ou l'excipient de ladite composition est formé d'une capsule à base de glycérine, de gélatine et d'amidon.

25 9. Composition pharmaceutique selon l'une des revendications  
1, 2, 6 et 7,

caractérisée en ce qu'elle se présente sous forme d'une solution liquide pulvérisable au moyen d'un fluide vecteur tel qu'un gaz.

30 10. Composition pharmaceutique selon l'une des revendications  
1, 2, 6 et 7,

caractérisée en ce qu'elle se présente sous forme d'une dose individuelle unique conditionnée de manière étanche à l'air dans un emballage jetable, la prise de la composition s'effectuant quotidiennement.

INSTITUT NATIONAL  
de la  
PROPRIETE INDUSTRIELLE

RAPPORT DE RECHERCHE  
PRELIMINAIRE

N° d'enregistrement national

établi sur la base des dernières revendications  
déposées avant le commencement de la recherche

FA 501229  
FR 9407803

Catégorie	Citation du document avec indication, en cas de besoin, des parties pertinentes	Revendications concernées de la demande examinée	DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS	
Y	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 013, no. 171 (C-588) 24 Avril 1989 & JP-A-64 003 117 (HARUMI OKUYAMA) 6 Janvier 1989 * abrégé * ----	1		
Y	REVUE FRANCAISE DES CORPS GRAS, vol.34, Octobre 1987, PARIS FR pages 463 - 464 A. BEKAERT ET AL, 'ETUDE DE LA FRACTION LIPIDIQUE DES GRAINES D'ACTINIDIA CHINENSIS (PLANCH.) DILLENIACEES OU KIWI.' ----	1		
				DOMAINES TECHNIQUES RECHERCHES (Int.Cl.)
				A61K
1	Date d'achèvement de la recherche  10 Mars 1995	Examinateur  Rempp, G		
<b>CATEGORIE DES DOCUMENTS CITES</b> <p>X : particulièrement pertinent à lui seul      Y : particulièrement pertinent en combinaison avec un autre document de la même catégorie      A : pertinent à l'encontre d'au moins une revendication ou arrête-plan technologique général      O : divulgation non-écrite      P : document intercalaire</p> <p>I : théorie ou principe à la base de l'invention      E : document de brevet bénéficiant d'une date antérieure à celle de la demande et qui n'a pas été publié qu'à cette date de dépôt ou qu'à une date postérieure.      D : cité dans la demande      L : cité pour d'autres raisons      A : membre de la même famille, document correspondant</p>				